

12 EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

21 Anmeldenummer: 86100722.7

61 Int. Cl.⁴: C 07 D 231/42
 A 01 N 43/56

22 Anmeldetag: 21.01.86

30 Priorität: 02.02.85 DE 3503609

43 Veröffentlichungstag der Anmeldung:
 03.09.86 Patentblatt 86/36

84 Benannte Vertragsstaaten:
 AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE

71 Anmelder: BAYER AG
 Konzernverwaltung RP Patentabteilung
 D-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

72 Erfinder: Schallner, Otto, Dr.
 Noldeweg 22
 D-4019 Monheim(DE)

72 Erfinder: Gehring, Reinhold, Dr.
 Dasnöckel 49
 D-5600 Wuppertal 11(DE)

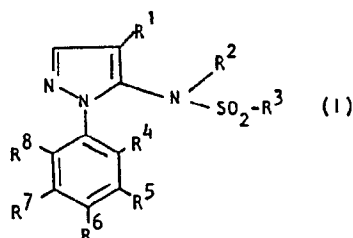
72 Erfinder: Stetter, Jörg, Dr.
 Gellertweg 4
 D-5600 Wuppertal 1(DE)

72 Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.
 Grünstrasse 9a
 D-5090 Leverkusen 1(DE)

72 Erfinder: Schmidt, Robert R., Dr.
 Im Waldwinkel 110
 D-5060 Bergisch Gladbach 2(DE)

64 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole.

67 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der Formel (I),



für Wasserstoff stehen, wobei

R⁹ für Alkyl, Halogenalkyl, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino steht und

n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,

Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Hervizide.

in welcher

R¹ für Wasserstoff, Nitro, Nitroso oder Halogen steht,
 R² für Wasserstoff, Alkyl, für einen Rest R³-SO₂- oder
 für ein salzartig gebundenes organisches oder anorgani-
 sches Kation steht,

R³ für Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Hydroxy-
 alkyl, Alkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituier-
 tes Aryl steht,

R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für Cyano, Nitro,
 Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Halogenalkyl, Halo-
 genalkoxy oder für einen Rest -S(O)_n-R⁹ stehen und

R⁶, R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander und von R⁴ und
 R⁵ für die gleichen Reste wie R⁴ und R⁵ stehen und zusätzlich

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

5090 Leverkusen, Bayerwerk

Konzernverwaltung RP
Patentabteilung

KM/Ke-c
Ib

5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole

Die Erfindung betrifft neue 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

5 Es ist bereits bekannt, daß bestimmte 1-Aryl-pyrazole, wie beispielsweise das 4-Cyano-5-propionamido-1-(2,3,4-trichlorphenyl)-pyrazol, herbizide insbesondere auch selektiv-herbizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. DE-OS 3 226 513).

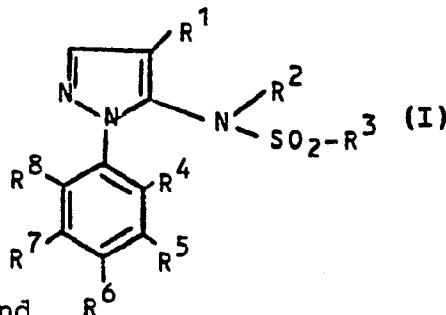
10

Die herbizide Wirksamkeit dieser vorbekannten 1-Aryl-pyrazole gegenüber Schädipflanzen ist jedoch ebenso wie ihre Verträglichkeit gegenüber wichtigen Kulturpflanzen nicht immer in allen Anwendungsbereichen völlig zufriedenstellend.

15

Es wurden neue 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der allgemeinen Formel (I),

20



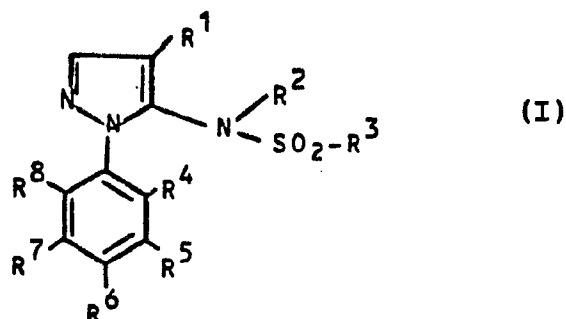
in welcher

- 5 R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso oder Halogen
steht,
- 10 R^2 für Wasserstoff, Alkyl, für einen Rest R^3-SO_2- oder
für ein salzartig gebundenes anorganisches oder
organisches Kation steht,
- 15 R^3 für Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl,
Hydroxyalkyl, Alkoxyalkyl oder für jeweils gege-
benenfalls substituiertes Aryl steht,
- 20 R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Nitro,
Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Halogen-
alkyl, Halogenalkoxy oder für einen Rest
 $-S(O)_n-R^9$ stehen und
- 25 R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4 und R^6
für die gleichen Reste wie R^4 und R^6 stehen und
zusätzlich für Wasserstoff stehen, wobei
- 30 R^9 für Alkyl, Halogenalkyl, Amino, Alkylamino oder
Dialkylamino steht und
- n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,
- gefunden.

Weiterhin wurde gefunden, daß man die neuen 5-Sulfon-
amido-1-aryl-pyrazole der allgemeinen Formel (I),

5

10



in welcher

15

R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso oder Halogen steht,

20

R^2 für Wasserstoff, Alkyl, für einen Rest R^3-SO_2- oder für ein salzartig gebundenes anorganisches oder organisches Kation steht,

25

R^3 für Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Hydroxyalkyl, Alkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

30

R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Nitro, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder für einen Rest $-S(O)_n-R^9$ stehen und

R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4 und R^6 für die gleichen Reste wie R^4 und R^6 stehen und zusätzlich für Wasserstoff stehen, wobei

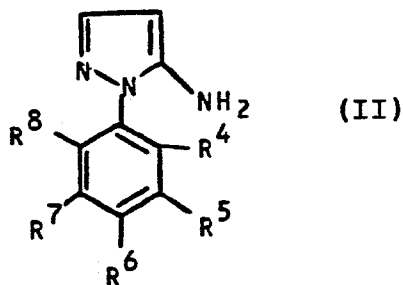
R^9 für Alkyl, Halogenalkyl, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino steht und

5

n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,

erhält, wenn man

10 (a) 5-Aminopyrazole der Formel (II),



15

in welcher

R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben,

20

mit Sulfonylchloriden der Formel (III),



25

in welcher

R^3 die oben angegebene Bedeutung hat,

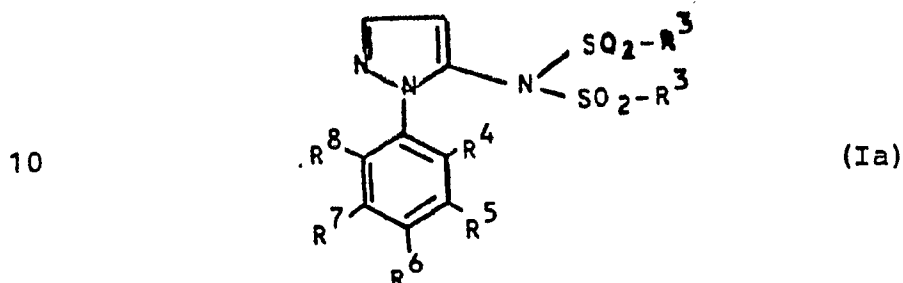
30

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

0192951

oder wenn man

- 5 (b) die nach Verfahren (a) erhältlichen Bisulfonylamine
der Formel (Ia),



in welcher

15

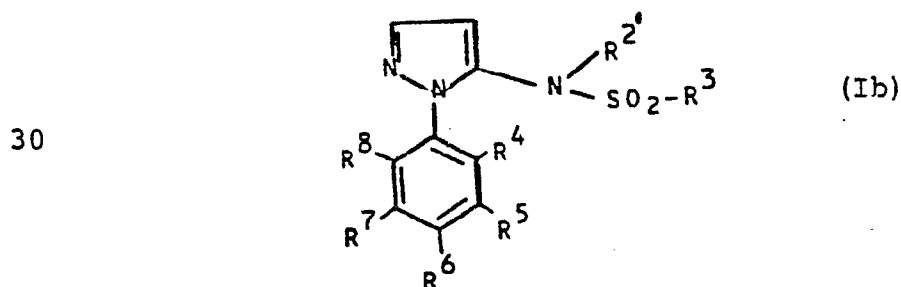
R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben

mit Basen gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels spaltet,

20

oder wenn man

- 25 (c) die nach Verfahren (a) oder (b) erhältlichen 5-Sulfonamido-pyrazole der Formel (Ib),



in welcher

5 $R^{2'}$ für Wasserstoff oder für einen Rest R^3-SO_2-
steht und

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 und R^8 die oben angegebene Be-
deutung haben,

10

mit elektrophilen Agenzien der Formel (IV),



15

in welcher

$R^{1'}$ für Halogen, Nitroso oder Nitro steht und

20

E für eine elektronenanziehende Abgangsgruppie-
rung steht,

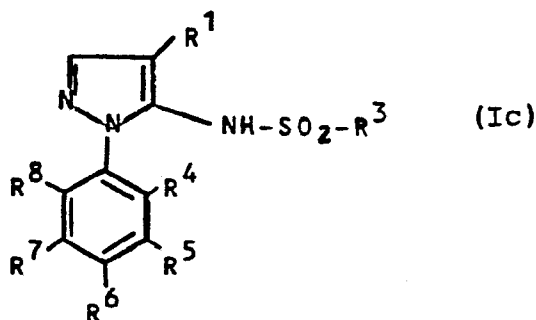
25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmit-
tels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Kata-
lysatoren oder Reaktionshilfsmittels in 4-Stellung
substituiert,

oder wenn man

30

(d) die nach Verfahren (a), (b) oder (c) erhältlichen
5-Sulfonamido-pyrazole der Formel (Ic),

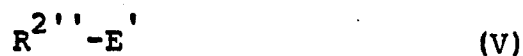


in welcher

5 $R^1, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ und R^8 die oben angegebene
Bedeutung haben,

entweder

10 (4) mit Alkylierungsmitteln der Formel (V),



in welcher

15

$R^{2''}$ für Alkyl steht und
 E' für eine elektronenanziehende Abgangs-
gruppe steht,

20 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines
Säurebindemittels bzw. Katalysators am Stick-
stoffatom der Sulfonamidogruppe alkyliert,

25 oder

(8) mit Verbindungen der Formel (VI),



30

in welcher

M^{\oplus} für ein Äquivalent eines anorganischen oder organischen Kations steht und

G^{\ominus} für ein Äquivalent eines geeigneten Gegenions steht,

umsetzt oder mit primären, sekundären oder tertiären Aminen gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels am Stickstoff der Sulfonamidogruppe ein Salz bildet.

Schließlich wurde gefunden, daß die neuen 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der allgemeinen Formel (I) herbizide, insbesondere auch selektiv-herbizide Eigenschaften besitzen.

Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der allgemeinen Formel (I) neben einer deutlich verbesserten allgemein-herbiziden Wirksamkeit gegenüber Schädipflanzen eine erheblich verbesserte Verträglichkeit gegenüber wichtigen Kulturpflanzen als die aus dem Stand der Technik bekannten 1-Aryl-pyrazole, wie beispielsweise das 4-Cyano-5-propionylamino-1-(2,3,4-trichlorphenyl)-pyrazol, welches eine chemisch und wirkungsmäßig naheliegende Verbindung ist.

Die erfindungsgemäßen 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), bei welchen

- R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso oder Halogen steht,
- 5 R^2 für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, für einen Rest R^3-SO_2- oder für ein Äquivalent eines Alkali- oder Erdalkali- oder Übergangsmetallkations oder für ein gegebenenfalls substituiertes Ammoniumion steht,
- 10 R^3 für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkenyl, Halogenalkyl, Alkoxyalkyl oder Hydroxyalkyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen und gegebenenfalls bis zu 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Nitro sowie jeweils niederes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Halogenalkyl substituiertes Benzyl oder Phenyl steht,
- 20 R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Halogen oder für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, außerdem für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen und bis zu 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen oder für einen Rest $-S(O)_n-R^9$ stehen,
- 30 und

0192951

5 R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4 und R^6 für die gleichen Reste wie R^4 und R^6 stehen und zusätzlich für Wasserstoff stehen, wobei

10 R^9 für Amino, sowie für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Halogenalkyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen und im Fall des Halogenalkyl mit bis zu 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und

15 n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), bei welchen

20 R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso, Fluor, Chlor, Brom oder Iod steht,

25 R^2 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für einen Rest R^3-SO_2- oder für ein Äquivalent eines Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Barium-, Kupfer-, Zink-, Mangan-, Zinn-, Eisen-, Cobalt- oder Nickelions steht, oder für ein gegebenenfalls ein- bis dreifach gleich oder verschieden durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder
30 Phenyl substituiertes Ammoniumion steht,

R^3 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Butenyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Chlormethyl,

- 5 Dichlormethyl, Trifluormethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder für jeweils gegebenenfalls ein- bis dreifach gleich oder verschieden substituiertes Benzyl oder Phenyl steht, wobei als Substituenten infrage kommen:
Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio oder Trifluormethyl,
- 10 R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n- und i-Propyl, n-, i-, s- und t-Butyl, für Methoxy, Ethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, für Tri-
- 15 fluormethyl, Trichlormethyl, Dichlorfluormethyl, Difluorchlormethyl, Chlormethyl, Dichlormethyl, Difluormethyl, Pentafluorethyl, Tetrafluorethyl, Trifluorchlorethyl, Trifluorethyl, Difluordichlorethyl, Trifluordichlorethyl, Pentachlorethyl,
- 20 für Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Chlormethoxy, Dichlormethoxy, Difluormethoxy, Pentafluorethoxy, Tetrafluorethoxy, Trifluorchlorethoxy, Trifluorethoxy, Difluordichlorethoxy, Trifluordichlorethoxy,
- 25 Pentachlorethoxy oder für einen Rest $-S(O)_n-R^9$ stehen und
- 30 R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4 und R^6 für die gleichen Reste wie R^4 und R^6 stehen und zusätzlich für Wasserstoff stehen, wobei

0192951

R^9 für Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Fluordichlormethyl, Difluormethyl, Tetrafluorethyl, Trifluorchlorethyl, Trifluormethyl, Methyl oder Ethyl steht und

n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht.

Im einzelnen seien außer den bei den Herstellungsbeispielen genannten Verbindungen die in der folgenden Tabelle aufgeführten 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der allgemeinen Formel (I) genannt:

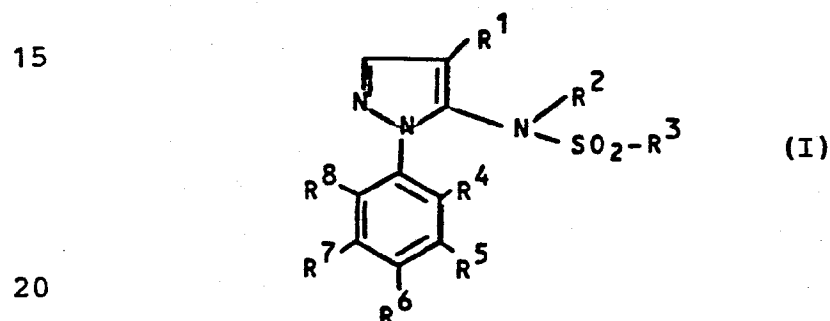




Tabelle 1




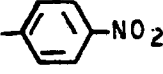
R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
H	H	CH ₃	Cl	H	Cl	H	Cl
H	H	CH ₃ 	Cl	H	Cl	H	Cl
H	H	CH ₃ 	Cl	H	CF ₃	H	Cl
H	H	CH ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
H	H	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	Br
H	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl

Le A 23 543 Ausland

Tabelle 1 (Fortsetzung)

<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁷</u>	<u>R⁸</u>
H	H	CH ₃	Cl	F	CF ₃	Cl	Cl
H	H	CH ₃	Cl	F	CF ₃	F	F
H	H	CH ₃	F	F	CF ₃	F	F
H	H	CH ₃	Cl	F	Cl	F	Cl
H	H	C ₂ H ₅	Cl	H	Br	H	Cl
H	H	CH ₃	F	F	F	F	F
H	C ₂ H ₅	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
H	(CH ₂) ₂ OH	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
H	H	CH ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
H	H	C ₄ H ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
H	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCF ₃	H	Cl
H	H	(CH ₂) ₂ Cl	Cl	Cl	SCF ₃	H	Cl
H	H	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
H	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Br	H	Br	H	Br
H	H	C ₄ F ₉	Br	H	CH ₃	H	H
H	H	C ₄ H ₉	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	H	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
H	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CCl ₂ F	H	Cl
H	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CClF ₂	H	Cl
H	CH ₃	CH ₂ Cl	Br	H	SCF ₃	H	Br
H	H	C ₄ H ₉	Br	H	SCF ₃	H	H
H	H	CH ₃	CF ₃	F	Cl	H	Cl
H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	Cl	H	H
H	H	C ₄ H ₉	CF ₃	H	Br	H	H
H	H	CH ₃	Cl	F	CN	F	Cl
H	H	CH ₃	F	F	CN	F	F
H	H	CH ₃	F	Cl	F	Cl	F
H	H		Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
H	CH ₃		Cl	H	OCF ₃	H	H
H	CH ₃		Cl	H	CF ₃	H	Cl
H	H		Cl	H	CF ₃	H	Cl
H	CH ₃	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
H	C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
H	(CH ₂) ₂ OH	C ₄ H ₉	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	Cl

0192951

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
H	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	H
H	H	CH ₃	Cl	H	SOCF ₃	H	H
H	H	CH ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
H	H	CF ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
H	CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
H	H	C ₄ F ₉	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
H	CH ₃	C ₄ F ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
H	H	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	H	H
H	H	CH ₃	Cl	H	NO ₂	H	Cl
H	H	CH ₃	NO ₂	H	NO ₂	H	H
H	H	CH ₃	Cl	H	CH ₃	H	Cl
H	H	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cl
H	H	CH ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₃	H	Cl
H	H	CH ₃	Br	H	OCF ₃	H	Cl
NO	H	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	Br
NO	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
NO	H	CH ₃	Cl	F	CF ₃	Cl	Cl

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
NO	H	CH ₃	CL	F	CF ₃	F	F
NO	H	CH ₃	F	F	CF ₃	F	F
NO	H	CH ₃	CL	F	CL	F	CL
NO	H	C ₂ H ₅	CL	H	Br	H	CL
NO	H	CH ₃	F	F	F	F	F
NO	C ₂ H ₅	CH ₂ CL	CL	H	CF ₃	H	H
NO	(CH ₂) ₂ OH	CF ₃	CL	CL	CL	H	H
NO	H	CH ₃	CL	H	OCF ₃	H	CL
NO	H	C ₄ H ₉	CL	H	SCF ₃	H	CL
NO	CH ₃	CH ₃	CL	CL	OCF ₃	H	CL
NO	H	(CH ₂) ₂ CL	CL	CL	SCF ₃	H	CL
NO	H	CF ₃	CL	CL	CL	H	CL
NO	H	CF ₃	CL	H	CL	H	CL
NO	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Br	H	Br	H	Br
NO	H	C ₄ F ₉	Br	H	CH ₃	H	H
NO	H	C ₄ H ₉	CL	H	OCF ₂ CHF ₂	H	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)



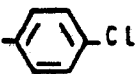
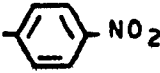
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
NO	H	CH ₃	CL	H	SO ₂ CCl ₂ F	H	CL
NO	H	CH ₃	CL	H	SO ₂ CClF ₂	H	CL
NO	CH ₃	CH ₂ CL	Br	H	SCF ₃	H	Br
NO	H	C ₄ H ₉	Br	H	SCF ₃	H	H
NO	H	CH ₃	CF ₃	F	CL	H	CL
NO	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	CL	H	H
NO	H	C ₄ H ₉	CF ₃	H	Br	H	H
NO	H	CH ₃	CL	F	CN	F	CL
NO	H	CH ₃	F	F	CN	F	F
NO	H	CH ₃	F	CL	F	CL	F
NO	H		CL	CL	CF ₃	H	CL
NO	CH ₃		CL	H	OCF ₃	H	H
NO	CH ₃		CL	H	CF ₃	H	CL
NO	H		CL	H	CF ₃	H	CL
NO	CH ₃	CH ₂ CL	CL	H	CF ₃	H	H
NO	C ₃ H ₇	CH ₃	CL	CL	CF ₃	H	CL
NO	(CH ₂) ₂ OH	C ₄ H ₉	CL	H	SO ₂ CF ₃	H	CL

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
NO	H	CH ₃	CL	H	SO ₂ CF ₃	H	H
NO	H	CH ₃	CL	H	SOCF ₃	H	H
NO	H	CH ₃	CL	CL	CL	H	CL
NO	H	CF ₃	CL	H	OCF ₃	H	CL
NO	CH ₃	CF ₃	CL	CL	CL	H	H
NO	H	C ₄ F ₉	CL	CL	CF ₃	H	CL
NO	CH ₃	C ₄ F ₉	CL	H	SCF ₃	H	CL
NO	H	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	H	H
NO	H	CH ₃	CL	H	NO ₂	H	CL
NO	H	CH ₃	NO ₂	H	NO ₂	H	H
NO	H	CH ₃	CL	H	CH ₃	H	CL
NO	H	CF ₃	CL	H	CH(CH ₃) ₂	H	CL
NO	H	CH ₂ CL	CL	H	C(CH ₃) ₃	H	CL
NO	H	CH ₃	Br	H	OCF ₃	H	CL
NO ₂	H	CH ₃	CL	H	CF ₃	H	Br
NO ₂	CH ₃	CH ₃	CL	CL	CF ₃	H	CL
NO ₂	H	CH ₃	CL	F	CF ₃	CL	CL
NO ₂	H	CH ₃	CL	F	CF ₃	F	F

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
NO_2	H	CH_3	F	F	CF_3	F	F
NO_2	H	CH_3	Cl	F	Cl	F	Cl
NO_2	H	C_2H_5	Cl	H	Br	H	Cl
NO_2	H	CH_3	F	F	F	F	F
NO_2	C_2H_5	CH_2Cl	Cl	H	CF_3	H	H
NO_2	$(CH_2)_2OH$	CF_3	Cl	Cl	Cl	H	H
NO_2	H	CH_3	Cl	H	OCF_3	H	Cl
NO_2	H	C_4H_9	Cl	H	SCF_3	H	Cl
NO_2	CH_3	CH_3	Cl	Cl	OCF_3	H	Cl
NO_2	H	$(CH_2)_2Cl$	Cl	Cl	SCF_3	H	Cl
NO_2	H	CF_3	Cl	Cl	Cl	H	Cl
NO_2	H	CF_3	Cl	H	Cl	H	Cl
NO_2	$CH(CH_3)_2$	CH_3	Br	H	Br	H	Br
NO_2	H	C_4F_9	Br	H	CH_3	H	H
NO_2	H	C_4H_9	Cl	H	OCF_2CHF_2	H	H
NO_2	H	CH_3	Cl	H	SO_2CCl_2F	H	Cl
NO_2	H	CH_3	Cl	H	SO_2CClF_2	H	Cl

0192951

Tabelle 1 (Fortsetzung)


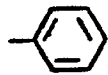

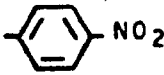
R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
NO_2	CH_3	CH_2Cl	Br	H	SCF_3	H	Br
NO_2	H	C_4H_9	Br	H	SCF_3	H	H
NO_2	H	CH_3	CF_3	F	Cl	H	Cl
NO_2	CH_3	CH_3	CF_3	H	Cl	H	H
NO_2	H	C_4H_9	CF_3	H	Br	H	H
NO_2	H	CH_3	Cl	F	CN	F	Cl
NO_2	H	CH_3	F	F	CN	F	F
NO_2	H	CH_3	F	Cl	F	Cl	F
NO_2	H		Cl	Cl	CF_3	H	Cl
NO_2	CH_3		Cl	H	OCF_3	H	H
NO_2	CH_3		Cl	H	CF_3	H	Cl
NO_2	H		Cl	H	CF_3	H	Cl
NO_2	CH_3	CH_2Cl	Cl	H	CF_3	H	H
NO_2	C_3H_7	CH_3	Cl	Cl	CF_3	H	Cl
NO_2	$(CH_2)_2OH$	C_4H_9	Cl	H	SO_2CF_3	H	Cl
NO_2	H	CH_3	Cl	H	SO_2CF_3	H	H
NO_2	H	CH_3	Cl	H	SO_2CF_3	H	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)

<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁷</u>	<u>R⁸</u>
NO ₂	H	CH ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
NO ₂	CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
NO ₂	H	C ₄ F ₉	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
NO ₂	CH ₃	C ₄ F ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
NO ₂	H	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	H	H
NO ₂	H	CH ₃	Cl	H	NO ₂	H	Cl
NO ₂	H	CH ₃	NO ₂	H	NO ₂	H	H
NO ₂	H	CH ₃	Cl	H	CH ₃	H	Cl
NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cl
NO ₂	H	CH ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₃	H	Cl
NO ₂	H	CH ₃	Br	H	OCF ₃	H	Cl
Cl	H	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	Br
Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
Cl	H	CH ₃	Cl	F	CF ₃	Cl	Cl
Cl	H	CH ₃	Cl	F	CF ₃	F	F
Cl	H	CH ₃	F	F	CF ₃	F	F

0192951

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
Cl	H	CH ₃	Cl	F	Cl	F	Cl
Cl	H	C ₂ H ₅	Cl	H	Br	H	Cl
Cl	H	CH ₃	F	F	F	F	F
Cl	C ₂ H ₅	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
Cl	(CH ₂) ₂ OH	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
Cl	H	CH ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Cl	H	C ₄ H ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCF ₃	H	Cl
Cl	H	(CH ₂) ₂ Cl	Cl	Cl	SCF ₃	H	Cl
Cl	H	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl
Cl	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Br	H	Br	H	Br
Cl	H	C ₄ F ₉	Br	H	CH ₃	H	H
Cl	H	C ₄ H ₉	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	H	H
Cl	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CCl ₂ F	H	Cl
Cl	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CClF ₂	H	Cl

0192951

Tabelle 1 (Fortsetzung)



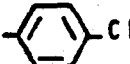

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
Cl	CH ₃	CH ₂ Cl	Br	H	SCF ₃	H	Br
Cl	H	C ₄ H ₉	Br	H	SCF ₃	H	H
Cl	H	CH ₃	CF ₃	F	Cl	H	Cl
Cl	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	Cl	H	H
Cl	H	C ₄ H ₉	CF ₃	H	Br	H	H
Cl	H	CH ₃	Cl	F	CN	F	Cl
Cl	H	CH ₃	F	F	CN	F	F
Cl	H	CH ₃	F	Cl	F	Cl	F
Cl	H		Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
Cl	CH ₃		Cl	H	OCF ₃	H	H
Cl	CH ₃		Cl	H	CF ₃	H	Cl
Cl	H		Cl	H	CF ₃	H	Cl
Cl	CH ₃	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
Cl	C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
Cl	(CH ₂) ₂ OH	C ₄ H ₉	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	Cl
Cl	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	H
Cl	H	CH ₃	Cl	H	SOCF ₃	H	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
CL	H	CH ₃	CL	CL	CL	H	CL
CL	H	CF ₃	CL	H	OCF ₃	H	CL
CL	CH ₃	CF ₃	CL	CL	CL	H	H
CL	H	C ₄ F ₉	CL	CL	CF ₃	H	CL
CL	CH ₃	C ₄ F ₉	CL	H	SCF ₃	H	CL
CL	H	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	H	H
CL	H	CH ₃	CL	H	NO ₂	H	CL
CL	H	CH ₃	NO ₂	H	NO ₂	H	H
CL	H	CH ₃	CL	H	CH ₃	H	CL
CL	H	CF ₃	CL	H	CH(CH ₃) ₂	H	CL
CL	H	CH ₂ CL	CL	H	C(CH ₃) ₃	H	CL
CL	H	CH ₃	Br	H	OCF ₃	H	CL
Br	H	CH ₃	CL	H	CF ₃	H	Br
Br	CH ₃	CH ₃	CL	CL	CF ₃	H	CL
Br	H	CH ₃	CL	F	CF ₃	CL	CL
Br	H	CH ₃	CL	F	CF ₃	F	F
Br	H	CH ₃	F	F	CF ₃	F	F

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
Br	H	CH ₃	Cl	F	Cl	F	Cl
Br	H	C ₂ H ₅	Cl	H	Br	H	Cl
Br	H	CH ₃	F	F	F	F	F
Br	C ₂ H ₅	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
Br	(CH ₂) ₂ OH	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
Br	H	CH ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Br	H	C ₄ H ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
Br	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCF ₃	H	Cl
Br	H	(CH ₂) ₂ Cl	Cl	Cl	SCF ₃	H	Cl
Br	H	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Br	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl
Br	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Br	H	Br	H	Br
Br	H	C ₄ F ₉	Br	H	CH ₃	H	H
Br	H	C ₄ H ₉	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	H	H
Br	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CCl ₂ F	H	Cl
Br	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CClF ₂	H	Cl

0192951

Tabelle 1 (Fortsetzung)


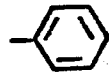

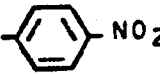
R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
Br	CH ₃	CH ₂ Cl	Br	H	SCF ₃	H	Br
Br	H	C ₄ H ₉	Br	H	SCF ₃	H	H
Br	H	CH ₃	CF ₃	F	Cl	H	Cl
Br	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	Cl	H	H
Br	H	C ₄ H ₉	CF ₃	H	Br	H	H
Br	H	CH ₃	Cl	F	CN	F	Cl
Br	H	CH ₃	F	F	CN	F	F
Br	H	CH ₃	F	Cl	F	Cl	F
Br	H		Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
Br	CH ₃		Cl	H	OCF ₃	H	H
Br	CH ₃		Cl	H	CF ₃	H	Cl
Br	H		Cl	H	CF ₃	H	Cl
Br	CH ₃	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
Br	C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
Br	(CH ₂) ₂ OH	C ₄ H ₉	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	Cl
Br	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	H
Br	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	H

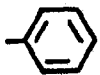


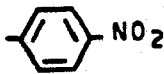
Tabelle 1 (Fortsetzung)

<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁷</u>	<u>R⁸</u>
Br	H	CH ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Br	H	CF ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Br	CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
Br	H	C ₄ F ₉	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
Br	CH ₃	C ₄ F ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
Br	H	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	H	H
Br	H	CH ₃	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Br	H	CH ₃	NO ₂	H	NO ₂	H	H
Br	H	CH ₃	Cl	H	CH ₃	H	Cl
Br	H	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cl
Br	H	CH ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₃	H	Cl
Br	H	CH ₃	Br	H	OCF ₃	H	Cl
I	H	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	Br
I	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
I	H	CH ₃	Cl	F	CF ₃	Cl	Cl
I	H	CH ₃	Cl	F	CF ₃	F	F
I	H	CH ₃	F	F	CF ₃	F	F

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
I	H	CH ₃	Cl	F	Cl	F	Cl
I	H	C ₂ H ₅	Cl	H	Br	H	Cl
I	H	CH ₃	F	F	F	F	F
I	C ₂ H ₅	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
I	(CH ₂) ₂ OH	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
I	H	CH ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
I	H	C ₄ H ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
I	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCF ₃	H	Cl
I	H	(CH ₂) ₂ Cl	Cl	Cl	SCF ₃	H	Cl
I	H	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
I	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl
I	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Br	H	Br	H	Br
I	H	C ₄ F ₉	Br	H	CH ₃	H	H
I	H	C ₄ H ₉	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	H	H
I	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CCl ₂ F	H	Cl
I	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CClF ₂	H	Cl

Tabelle 1 (Fortsetzung)

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
I	CH ₃	CH ₂ Cl	Br	H	SCF ₃	H	Br
I	H	C ₄ H ₉	Br	H	SCF ₃	H	H
I	H	CH ₃	CF ₃	F	Cl	H	Cl
I	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	Cl	H	H
I	H	C ₄ H ₉	CF ₃	H	Br	H	H
I	H	CH ₃	Cl	F	CN	F	Cl
I	H	CH ₃	F	F	CN	F	F
I	H	CH ₃	F	Cl	F	Cl	F
I	H		Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
I	CH ₃		Cl	H	OCF ₃	H	H
I	CH ₃		Cl	H	CF ₃	H	Cl
I	H		Cl	H	CF ₃	H	Cl
I	CH ₃	CH ₂ Cl	Cl	H	CF ₃	H	H
I	C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
I	(CH ₂) ₂ OH	C ₄ H ₉	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	Cl

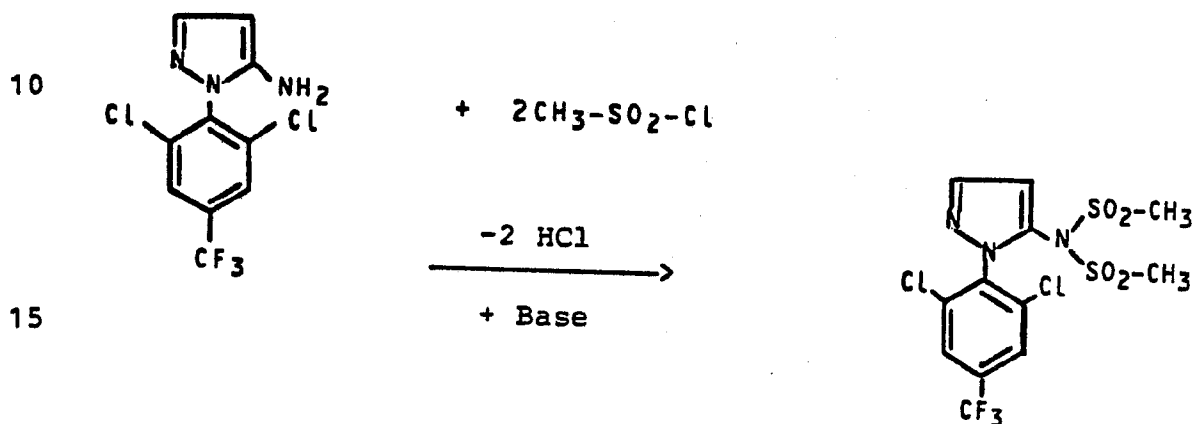
0192951

Tabelle 1 (Fortsetzung)

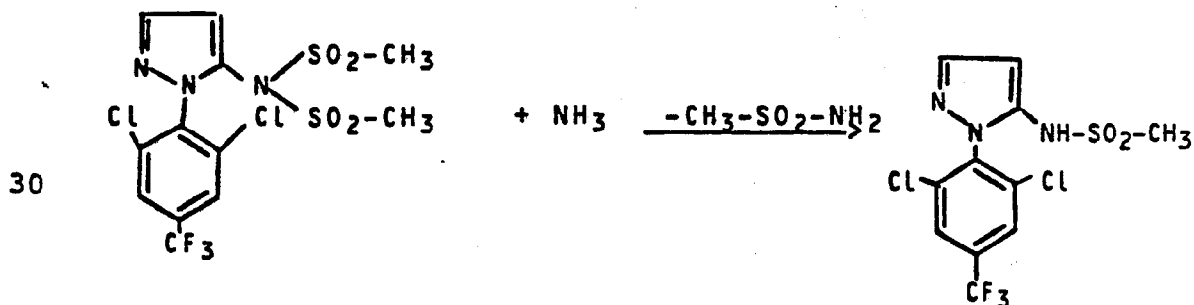
R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
I	H	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	H
I	H	CH ₃	Cl	H	SOCF ₃	H	H
I	H	CH ₃	Cl	Cl	Cl	H	Cl
I	H	CF ₃	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
I	CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	Cl	H	H
I	H	C ₄ F ₉	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl
I	CH ₃	C ₄ F ₉	Cl	H	SCF ₃	H	Cl
I	H	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	H	H
I	H	CH ₃	Cl	H	NO ₂	H	Cl
I	H	CH ₃	NO ₂	H	NO ₂	H	H
I	H	CH ₃	Cl	H	CH ₃	H	Cl
I	H	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cl
I	H	CH ₂ Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₃	H	Cl
I	H	CH ₃	Br	H	OCF ₃	H	Cl

0192951

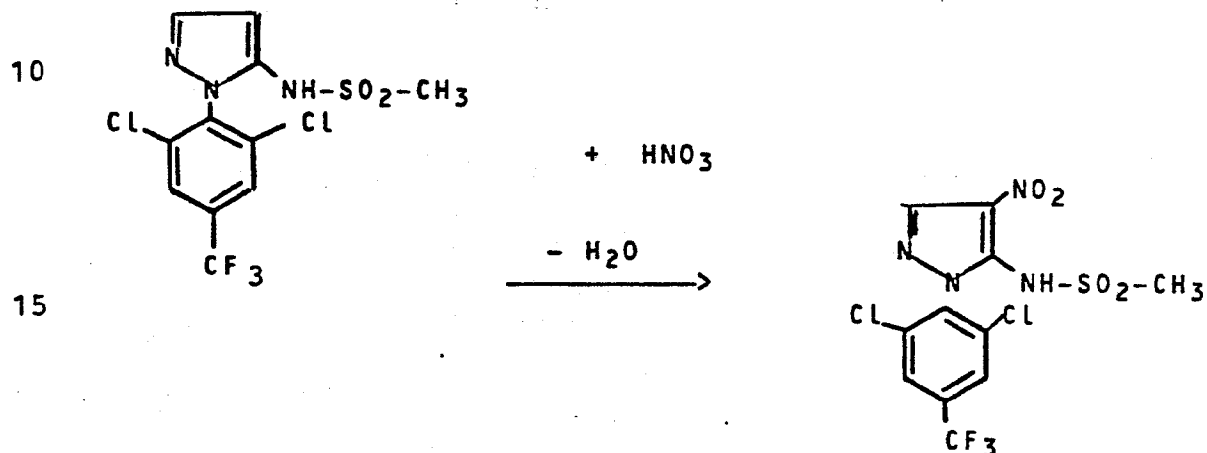
Verwendet man beispielsweise 5-Amino-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethyl)-phenyl-pyrazol und Methansulfonsäure-chlorid als Ausgangsstoffe, so läßt sich der Reaktions-
 5 ablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema darstellen:



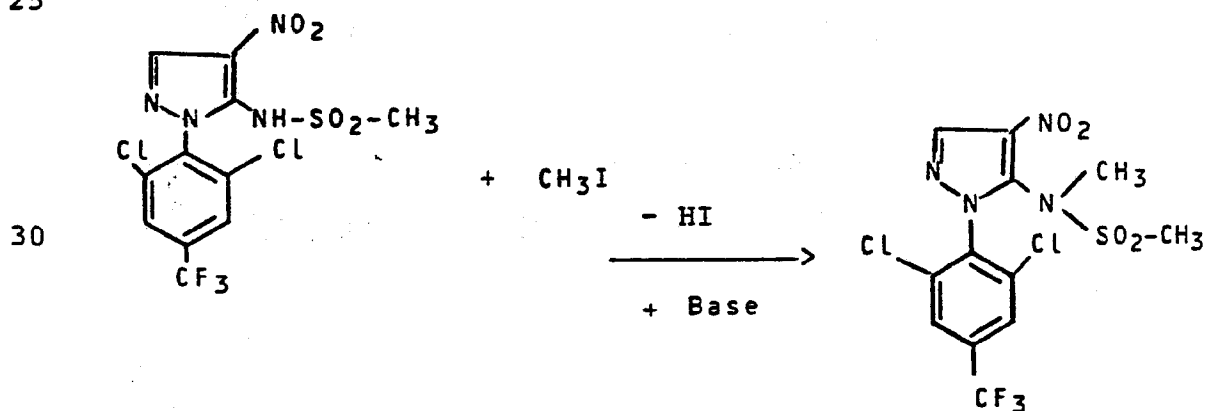
20 Verwendet man beispielsweise 5-[N,N-Bis-(methansulfonyl)-amino]-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethyl)-phenyl-pyrazol und Ammoniak als Ausgangsstoffe, so läßt sich der Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch
 25 das folgende Formelschema darstellen:



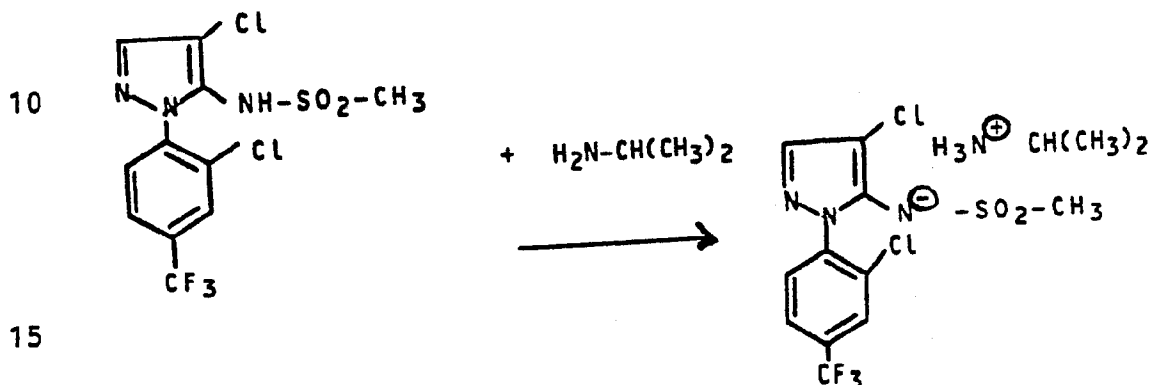
Verwendet man beispielsweise 5-Methansulfonamido-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethyl)-phenyl-pyrazol und Salpetersäure als Ausgangsstoffe, so läßt sich der Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema darstellen:



20 Verwendet man beispielsweise 4-Nitro-5-methansulfonamido-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethyl)phenyl-pyrazol und Methyljodid als Ausgangsstoffe, so läßt sich der Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (d-α) durch das folgende Formelschema darstellen:



Verwendet man beispielsweise 4-Chlor-5-methan-sulfon-
amido-1-(2-chlor-4-trifluormethyl)-phenyl-pyrazol und
Isopropylamin als Ausgangsstoffe, so läßt sich der
5 Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (d-β)
durch das folgende Formelschema darstellen:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
(a) als Ausgangsstoffe benötigten 5-Aminopyrazole sind
durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser
20 Formel (II) stehen R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ vorzugsweise
für diejenigen Substituenten, die bereits im Zusammen-
hang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen
Stoffe der Formel (I) als bevorzugt für diese Reste
genannt wurden.

25

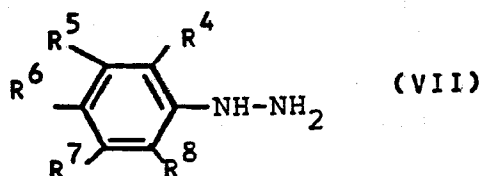
Die 5-Aminopyrazole der Formel (II) sind teilweise be-
kannt (vgl. z.B. J. Org. Chemistry 36, 2972-2974
(1971); J. Heterocycl. Chem. 7, 345-349 (1970);
C.A. 62 13 137c).

30

Die noch nicht bekannten substituierten 5-Aminopyrazole
der Formel (II) sind jedoch Gegenstand einer eigenen
vorgängigen Patentanmeldung (DE-P 3 402 308 vom
24.01.84).

Man erhält sie beispielsweise, wenn man Phenylhydrazine der Formel (VII),

5



10 in welcher

R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben,

15 mit 2-Halogen-acrylnitrilen der Formel (VIIIa),



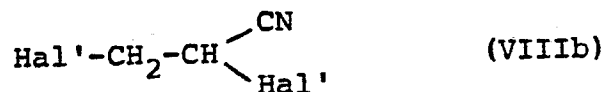
20 in welcher

Hal für Halogen, insbesondere für Chlor oder Brom steht,

oder

25

mit 2,3-Dihalogenpropionitrilen der Formel (VIIIb)

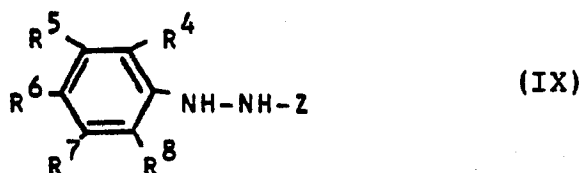


30

in welcher

Hal' für Halogen, insbesondere für Chlor oder Brom steht,

entweder zunächst in einer 1. Stufe, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise Methanol, sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie beispielsweise Schwefelsäure, bei Temperaturen zwischen -30°C und +50°C umgesetzt zu den Phenylhydrazin-Derivaten der Formel (IX),



in welcher

15 R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben und

20 Z für einen der Reste $-\text{CH}_2-\text{CH} \begin{matrix} \text{CN} \\ \text{Hal} \end{matrix}$ oder

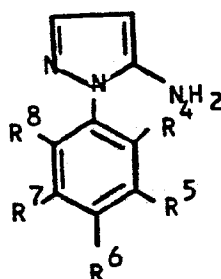
$-\text{CH}_2-\text{CH} \begin{matrix} \text{CN} \\ \text{Hal}' \end{matrix}$ steht, wobei Hal und Hal' für

gleiche oder unterschiedliche Halogenatome stehen,

25 und diese in einer 2. Stufe, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise Methanol, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels, wie beispielsweise Natriumcarbonat, bei Temperaturen zwischen 50°C und 150°C cyclisiert, oder
30 direkt in einem Reaktionsschritt ohne Isolierung der Zwischenstufe der Formel (IX), gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise Ethanol, bei Temperaturen zwischen 50°C und 150°C direkt cyclisiert zu den 5-Amino-pyrazolen der

Formel (II),

5



(II)

in welcher

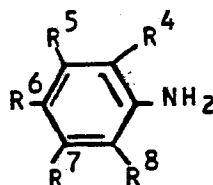
10

R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben.

15

Die Phenylhydrazine der Formel (VII) sind größtenteils bekannt oder können nach bekannten Verfahren in einfacher, analoger Weise hergestellt werden (vgl. z.B. Houben-Weyl "Methoden der organischen Chemie" Band X,2, Thieme Verlag Stuttgart 1967), indem man beispielsweise die bekannten Aniline der Formel (X),

20



(X)

25

in welcher

R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

30

mit Natriumnitrit in Gegenwart einer Säure, wie beispielsweise Schwefelsäure, und dann mit Zinn-(II)-chlorid, ebenfalls in Gegenwart einer Säure, wie beispielsweise Salzsäure, bei Temperaturen zwischen -20°C und +80°C umsetzt.

Die 2-Halogen-acrylnitrile der Formel (VIIIa) und die
2,3-Dihalogen-propionitrile der Formel (VIIIb) sind
5 ebenfalls bekannt (vgl. z.B. J. Prakt. Chemie 321, 93
(1979); J. Heterocyclic Chem. 19, 1265 (1982);
J. Heterocyclic Chem. 19, 1267 (1982)).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
10 (a) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Sulfonyl-
chloride sind durch die Formel (III) allgemein defi-
niert. Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (III),
bei welchen R^3 vorzugsweise für diejenigen Reste steht,
die bereits bei der Beschreibung der erfindungsgemäßen
15 Stoffe der Formel (I) als bevorzugt für diesen Substi-
tuenten genannt wurden.

Die Sulfonylchloride der Formel (III) sind allgemein
bekannte Verbindungen der organischen Chemie.
20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
(b) als Ausgangsstoffe benötigten Bisulfonylamine sind
durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser
Formel (Ia) stehen R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 vorzugs-
25 weise für diejenigen Substituenten, die bereits bei der
Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I)
als bevorzugt für diese Reste genannt wurden.

Die Bisulfonylamine sind erfindungsgemäße Stoffe und
30 erhältlich mit der Hilfe des erfindungsgemäßen Ver-
fahrens (a).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
(c) als Ausgangsstoffe benötigten 5-Sulfonamido-pyrazole
5 sind durch die Formel (Ib) allgemein definiert. In die-
ser Formel (Ib) stehen R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 vor-
zugsweise für diejenigen Substituenten, die bereits im
Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen
Stoffe der Formel (I) als bevorzugt für diese Reste
10 genannte wurden. $R^{2'}$ steht vorzugsweise für Wasserstoff
oder für einen Rest R^3-SO_2- .

Die 5-Sulfonamido-pyrazole der Formel (Ib) sind erfin-
dungsgemäße Stoffe und erhältlich mit Hilfe der erfin-
15 dungsgemäßen Verfahren (a) oder (b).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
(c) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten elektro-
philen Agenzien sind durch die Formel (IV) allgemein
20 definiert. In dieser Formel (IV) steht $R^{1'}$ vorzugs-
weise für Chlor, Brom, Iod, Nitroso oder Nitro. E
steht vorzugsweise für Halogen, insbesondere Chlor
oder Brom, für Hydroxy, für Alkyl, für Alkyl- oder
Arylsulfonyloxy, für Alkanoyloxy oder Aroyloxy. Weiter-
25 hin verwendbare elektrophile Reagenzien sind Sulfuryl-
chlorid, Phosphorpentachlorid, Nitriersäure und andere
üblicherweise zu elektrophilen Substitutionen verwend-
baren Stoffe. Die elektrophilen Agenzien der Formel
(IV) ebenso wie die weiteren üblichen elektrophilen
30 Reagenzien sind allgemein bekannte Verbindungen.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
(d) als Ausgangsstoffe benötigten 5-Sulfonamido-pyrazole
sind durch die Formel (Ic) allgemein definiert. In

0192951

dieser Formel (Ic) stehen R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 vorzugsweise für diejenigen Substituenten, die bereits
5 im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) als bevorzugt für diese Reste genannt wurden.

Die 5-Sulfonamido-pyrazole der Formel (Ic) sind erfindungsgemäße Verbindungen und erhältlich mit Hilfe der
10 erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) oder (c).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d- δ) weiterhin als Ausgangsverbindungen benötigten
15 Alkylierungsmittel sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) steht $R^{2'}$ vorzugsweise für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, sowie n-, i-, s- oder t-Butyl. E' steht
20 vorzugsweise für Chlor, Brom oder Iod, p-Toluolsulfonyloxy oder Alkoxysulfonyloxy, insbesondere für Chlor, Brom, Iod oder Methoxysulfonyloxy bzw. Ethoxysulfonyloxy. Die Alkylierungsmittel der Formel (V) sind allgemein bekannte Verbindungen der organischen Chemie.

25 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d- δ) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Salzbildner sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. Vorzugsweise verwendet man Alkali-, Erdalkali-, Ammonium- oder Übergangsmetallhydroxide, -oxide, -carbonate,
30 -hydrogencarbonate oder leicht lösliche -chloride, -sulfate, -phosphate oder -nitrate, wie beispielsweise

5 Natrium-, Kalium-, Calciumhydroxid, -carbonat oder
-hydrogencarbonat, Calciumchlorid, Bariumchlorid,
Kupfersulfat, Nickelchlorid oder Cobaltnitrat oder Al-
kylamine, wie Triethylamin, Isopropylamin, Diisopro-
pylamin, Butylamin.

10 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungs-
gemäßen Verfahrens (a) kommen inerte organische Lö-
sungsmittel infrage.

15 Vorzugsweise verwendet man aliphatische oder aromatische,
gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie
beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Pentan,
Hexan, Heptan, Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Methy-
lenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlor-
benzol oder Dichlorbenzol, Ether, wie Diethylether,
20 Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethy-
lenglykoldiethylether oder -dimethylether, Ketone,
wie Aceton, Butanon, Methylisopropylketon oder Methyl-
isobutylketon, Ester, wie Essigsäureethylester,
Nitrile, wie Acetonitril oder Propionitril, Amide,
wie Dimethylformamid, Diethylformamid, Dimethyl-
25 acetamid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphor-
säuretriamid.

30 Als Säurebindemittel zur Durchführung des Herstellungs-
verfahrens (a) kommen alle üblicherweise verwendbaren
anorganischen und organischen Basen infrage. Vorzugs-
weise verwendet man Alkalimetallhydride-, -hydroxide,
-amide, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie bei-

5 spielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriumhydroxid, Natriumcarbonat oder Natriumhydrogencarbonat oder auch tertiäre Amine, wie beispielsweise Triethylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, 4-(N,N-Dimethylamino)-pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

10 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des Herstellungsverfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen -20°C und 150°C , vorzugsweise zwischen 0°C und $+100^{\circ}\text{C}$.

15 Zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (a) setzt man pro Mol 5-Amino-pyrazol der Formel (II) im allgemeinen 1,0 bis 20 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 15 Mol an Sulfonylchlorid der Formel (III) und gegebenenfalls 1,0 bis 3,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 2,0 Mol an Säurebindemittel ein. Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte der Formel (I) erfolgt in allgemein üblicher Art und Weise.

25 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) kommen polare organische Lösungsmittel oder deren Gemische mit Wasser infrage. Vorzugsweise verwendet man Alkohole wie Methanol, Ethanol oder Propanol oder deren Gemische mit Wasser.

30

5 Als basische Reaktionsteilnehmer bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Vorzugsweise verwendet man Amine oder Ammoniaklösungen oder Alkalimetallcarbonate bzw. -hydrogencarbonate, wie Natrium- oder Kaliumcarbonat oder Natriumhydrogencarbonat.

10 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen 0°C und 80°C, vorzugsweise zwischen 20°C und
15 40°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man pro Mol Bis-sulfonylamin der Formel (Ia) im allgemeinen 1,0 bis 30,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis
20 15,0 Mol, an Base ein.

Die Reaktionsmischung wird in einem geeigneten Verdünnungsmittel so lange gerührt (30 Minuten bis 20 Stunden) bis bei chromatographischer Kontrolle kein Ausgangsprodukt mehr nachweisbar ist. Die Aufarbeitung
25 der Reaktionsprodukte der Formel (I) erfolgt nach üblichen Methoden.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (c) kommen alle üblicherweise für derartige elektrophile Substitutionen verwendbaren Lösungsmittel
30 infrage. Vorzugsweise verwendet man die als Reagenzien

0192951

infrage kommenden Säuren oder Gemische, wie beispielsweise Schwefelsäure, Salpetersäure, Sulfurylchlorid
5 oder Nitriersäure gleichzeitig als Verdünnungsmittel.
Es kommen gegebenenfalls auch inerte organische Lösungsmittel, wie beispielsweise Eisessig, Ethanol
oder chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid,
Chloroform oder Tetrachlorkohlenstoff, als Verdün-
10 nungsmittel infrage.

Als Katalysatoren oder Reaktionshilfsmittel zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (c) kommen ebenfalls die für derartige Reaktionen üblichen Kataly-
15 satoren infrage; vorzugsweise Salzsäure, Schwefelsäure, Eisen-II-chlorid oder andere Lewis-Säuren oder Acetanhydrid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung
20 des Herstellungsverfahrens (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen -50°C und +200°C, vorzugsweise zwischen -20°C und +150°C.

25 Zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (c) setzt man pro Mol 5-Amino-pyrazol der Formel (Ib) im allgemeinen 1,0 bis 10,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 5,0 Mol, an elektrophilem Agens der Formel (IV) und gegebenenfalls 0,1 bis 10 Mol an Katalysator oder Reaktions-
30 hilfsmittel ein. Die Reaktionsführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte der Formel (I) erfolgt in allgemein üblicher Art und Weise.

5 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (d- α) kommen ebenfalls inerte organische Lösungsmittel infrage. Vorzugsweise verwendet man die bei dem Herstellungsverfahren (a) genannten Lösungsmittel.

10 Als Säurebindemittel oder Katalysator zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (d- α) kommen alle üblicherweise verwendbaren organischen oder anorganischen Basen infrage. Vorzugsweise verwendet man die bei Verfahren (a) genannten Basen.

15 Die Reaktionstemperaturen können bei dem Herstellungsverfahren (d- α) ebenfalls in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen -20°C und $+120^{\circ}\text{C}$, vorzugsweise zwischen 0°C und $+90^{\circ}\text{C}$.

20 Zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (d- α) setzt man pro Mol 5-Sulfonamidopyrazol der Formel (Ic) im allgemeinen 1,0 bis 5,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 3,0 Mol, an Alkylierungsmittel der Formel (V) und gegebenenfalls 1,0 bis 5,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 3,0 Mol, an Säurebindemittel ein. Die Reaktionsführung, 25 Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte der Formel (I) erfolgt in üblicher Art und Weise.

30 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des Herstellungsverfahrens (d-B) kommen polare organische Lösungsmittel, Wasser oder wäßrige Gemische infrage. Vorzugsweise verwendet man Alkohole, wie beispielsweise Methanol, Ethanol oder Propanol, deren wäßrige Gemische oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung
des Herstellungsverfahrens (d-B) ebenfalls in einem
5 größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbei-
tet man zwischen 0°C und +80°C, vorzugsweise zwischen
+20°C und +40°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d-B)
10 setzt man pro Mol 5-Sulfonamidopyrazol der Formel (Ic)
im allgemeinen 1,0 bis 10 Mol, vorzugsweise 1,0 bis
5,0 Mol an Salzbildner der Formel (VI) oder Amin ein.

Zur Herstellung der Natrium-, Kalium- oder Ammonium-
15 salze setzt man eine Verbindung der Formel (Ic) in
wäßriger Lösung oder einem organischen Lösungsmittel,
wie Aceton, Methanol, Ethanol oder Dimethylformamid,
mit Natrium-, Kalium- oder Ammoniumhydroxid oder einem
Amin um und isoliert die Salze durch Abfiltrieren
20 oder durch Eindampfen der Lösung und reinigt sie ge-
gebenenfalls durch Umkristallisieren.

Die Calcium-, Barium-, Magnesium-, Mangan-, Kupfer-,
Nickel-, Zinn-, Eisen- und Cobaltsalze werden herge-
25 stellt aus den Natriumsalzen durch Behandeln mit einem
entsprechenden anorganischen Metallsalz, z.B. Calcium-
chlorid, Bariumchlorid, Kupfersulfat, Nickelchlorid
oder Cobaltnitrit. Die Calciumsalze können auch her-
gestellt werden durch Behandeln einer Verbindung der
30 Formel (Ic) mit Calciumhydroxid.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliantes, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als
5 Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten
10 Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

15 Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Linder-
20 nia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia,
25 Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea,
30 Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

0192951

5 Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum,
Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ana-
nas, Asparagus, Allium.

10 Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist je-
doch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern
erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflan-
zen.

15 Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Kon-
zentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie-
und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne
Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkraut-
bekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst-, Ziergehölz-,
Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-,
Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanla-
gen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen
20 Kulturen eingesetzt werden.

25 Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit
besonders gutem Erfolg zur selektiven Bekämpfung mono-
und dikotyler Unkräuter in monokotylen Kulturen wie
beispielsweise Weizen einsetzen.

30

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpul-
5 ver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoffimprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

10 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von ober-
flächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder
15 Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslo-
sungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel
20 kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine,
25 z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

30

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:
z. B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit,

Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder
in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten
Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei
5 Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide wie z.B.
1-Amino-6-ethylthio-3-(2,2-dimethylpropyl)-1,3,5-tria-
10 zin-2,4(1H,3H)-dion oder N-(2-Benzthiazolyl)-N,N'-di-
methyl-harnstoff zur Unkrautbekämpfung in Getreide; 4-
Amino-3-methyl-6-phenyl-1,2,4-triazin-5(4H)-on zur Un-
krautbekämpfung in Zuckerrüben und 4-Amino-6-(1,1-di-
methylethyl)-3-methylthio-1,2,4-triazin-5(4H)-on zur
15 Unkrautbekämpfung in Sojabohnen, in Frage.

Auch Mischungen mit N,N-Dimethyl-N'-(3-trifluormethyl-
phenyl)-harnstoff, N,N-Dimethyl-N'-(3-chlor-4-methyl-
phenyl)-harnstoff; N,N-Dimethyl-N'-(4-isopropylphenyl)-
20 harnstoff; 2,4-Dichlorphenoxyessigsäure; 2,4-Dichlor-
phenoxypropionsäure; (2-Methyl-4-chlorphenoxy)-essig-
säure; (4-Chlor-2-methyl-phenoxy)-propionsäure; 2-[4-
(3,5-Dichlorpyrid-2-yloxy)-phenoxy]-propionsäure-(2-
benzyloxy-ethylester), -(trimethylsilylmethylester)
25 oder -(2,2-diethoxyethylester); Methyl-5-(2,4-dichlor-
phenoxy)-2-nitrobenzoat; 3,5-Diod-4-hydroxybenzonitril;
3-Isopropyl-2,1,3-benzothiadiazin-4-on-2,2-dioxid; 2-
Chlor-N- <[4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-
amino]-carbonyl >-benzolsulfonamid, 4-Ethylamino-2-t-
30 butylamino-6-methylthio-s-triazin; N-Methyl-2-(benz-
thiazol-2-yloxy)-acetamid; N-(1-Ethylpropyl)-3,4-dimethyl-
2,6-dinitroanilin; o-Chlor-1',6'-diethyl-N-(2-propoxy-
ethyl)-acetanilid oder N,N-Diisopropyl-(2,3,3-trichlor-
allyl)-thiocarbamat, sind möglich. Einige Mischungen
zeigen überraschenderweise auch synergistische Wirkung.

5 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

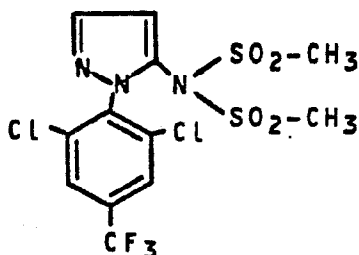
10 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden.

20 Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

25 Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 0,01 und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 0,05 und 5 kg pro ha.

30 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:Beispiel 1

nach Verfahren (a):

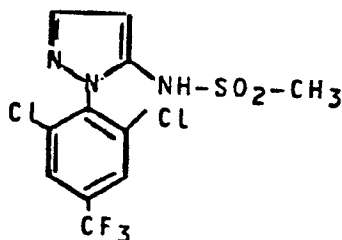
5,9 g (0,02 Mol) 5-Amino-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)-pyrazol werden in 40 ml Methylenchlorid gelöst und tropfenweise mit 4 ml ($\approx 3,9$ g $\approx 0,047$ Mol) Methansulfonylchlorid versetzt. Es wird 8 Stunden unter Rückfluß erhitzt, abgekühlt und nacheinander mit Wasser, verdünnter Salzsäure und gesättigter Bicarbonat-Lösung gewaschen. Die organische Phase wird über Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum eingedampft.

Man erhält 7,6 g Rohprodukt, das aus mono- und bimesyliertem Aminopyrazol besteht. Das gesamte Rohprodukt wird in ca. 20 ml Ethanol verrührt. Der unlösliche Rückstand wird filtriert, gewaschen und getrocknet.

Man erhält 1,3 g (14 % der Theorie) 5-Bis-(methansulfonyl)-imido-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)pyrazol vom Schmelzpunkt 196-198°C.

Beispiel 2

5



10

nach Verfahren (a):

Das ethanollösliche Filtrat aus Beispiel 1 wird mit etwas Aktivkohle versetzt, filtriert und eingedampft.

15

Man erhält ein bräunliches Öl, das langsam auskristallisiert. Ausbeute: 5,0 g (67 % der Theorie) 5-Methansulfonamido-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)-pyrazol vom Schmelzpunkt 64-67°C.

20

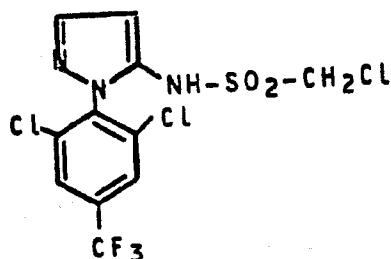
nach Verfahren (b):

2 g (4,4 mMol) 5-Bis-(methansulfon)-imido-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)-pyrazol werden in einer Mischung aus 5 ml Ethanol und 5 ml konzentrierter Ammoniaklösung suspendiert und 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt; dabei geht die Suspension in Lösung. Das Lösungsmittel wird im Vakuum abdestilliert und der ölige Rückstand in Methylenchlorid und verdünnter Salzsäure aufgenommen. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Kochsalzlösung gewaschen und über Magnesiumsulfat getrocknet. Nach Eindampfen im

30

Vakuum erhält man 1,5 g (91 % der Theorie) 5-Methan-
sulfonamido-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)-
pyrazol vom Schmelzpunkt 65-67°C.

Beispiel 3

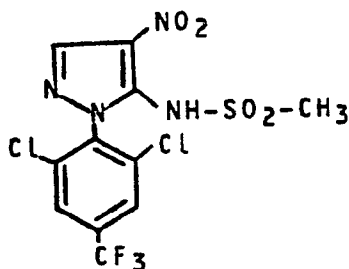


nach Verfahren (a):

10 g (0,034 Mol) 5-Amino-1-(2,6-dichlor-4-trifluor-
methylphenyl)-pyrazol werden in 35 ml Pyridin gelöst.
Bei 0°C bis 5°C werden 21,4 g (0,068 Mol) 47 %iges
Chlormethansulfochlorid gelöst in 1,2-Dichlorbenzol
zugetropft. Es wird fünf Stunden gerührt, wobei die
Temperatur langsam auf 20°C ansteigt. Danach wird der
Ansatz in Eiswasser ausgetragen und mit Methyl-
chlorid extrahiert. Die organische Phase wird abge-
trennt, mit verdünnter Salzsäure gewaschen und mit
dreimal 100 ml gesättigter Natriumhydrogencarbonat-
Lösung extrahiert. Die vereinigten wäßrigen Phasen
werden mit 10 %iger Salzsäure auf pH 1 gestellt und
das ausgefallene Produkt in Methylenchlorid aufge-
nommen. Die Methylenchlorid-Phase wird abgetrennt,
mit gesättigter Kochsalzlösung gewaschen, über Mag-
nesiumsulfat getrocknet und eingeengt.

Man erhält 8,7 g (63 % der Theorie) 5-Chlormethansul-
fonamido-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)-
5 pyrazol vom Schmelzpunkt 63-66°C.

Beispiel 4



15

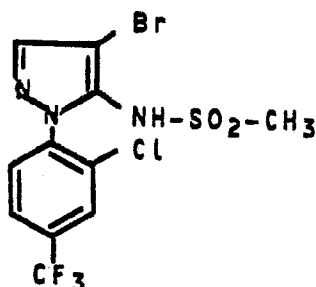
nach Verfahren (c):

3,2 g (8,6 mMol) 5-Methansulfonamido-1-(2,6-dichlor-
4-trifluormethylphenyl)-pyrazol werden in 10 ml Eis-
20 essig gelöst und bei 10°C bis 15°C nacheinander mit
0,8 ml (8,6 mMol) Essigsäureanhydrid und 0,4 ml
(9,3 mMol) 98 %iger Salpetersäure versetzt. Es wird
16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, im Vakuum einge-
engt und in 50 ml Methylenchlorid aufgenommen. Diese
25 Lösung wird dreimal mit je 50 ml gesättigter Natrium-
bicarbonatlösung extrahiert. Die vereinigten wäßrigen
Phasen werden mit verdünnter Salzsäure auf pH 1 ge-
stellt, der entstehende Niederschlag wird in Methylen-
chlorid gelöst und von der wäßrigen Phase getrennt.
30 Es wird mit Kochsalzlösung gewaschen und über Magne-
siumsulfat getrocknet. Nach dem Abziehen des Lösungs-
mittels im Vakuum erhält man 2,8 g (78 % der Theorie)
5-Methansulfonamido-4-nitro-1-(2,6-dichlor-4-trifluor-
methylphenyl)-pyrazol vom Schmelzpunkt 163°C.

Beispiel 5

5

10

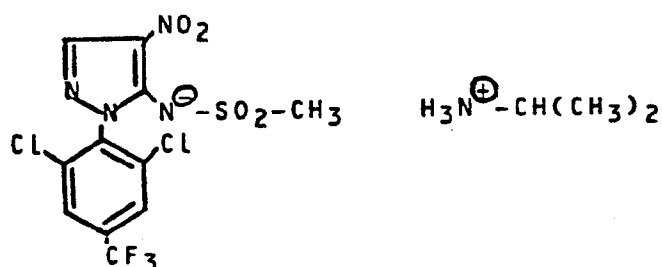


nach Verfahren (c):

3,4 g (0,01 Mol) 5-Methansulfonamido-1-(2-chlor-4-tri-
fluormethylphenyl)-pyrazol werden in 20 ml Methylen-
chlorid gelöst und mit 0,52 ml (0,01 Mol) Brom, gelöst
in 5 ml Methylenchlorid, versetzt. Nach beendeter Zu-
gabe wird eine Stunde nachgerührt, mit 20 ml Methylen-
chlorid verdünnt und nacheinander mit Bicarbonat-,
Thiosulfat- und Kochsalzlösung gewaschen. Die orga-
nische Lösung wird dann über Magnesiumsulfat getrock-
net und im Vakuum eingeeengt.

Man erhält 3,4 g (91 % der Theorie) 4-Brom-5-methansul-
fonamido-1-(2-chlor-4-trifluormethylphenyl)-pyrazol
vom Schmelzpunkt 63-65°C

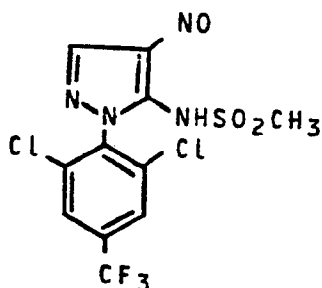
30

Beispiel 6

nach Verfahren (d-B):

15 3 g (7,2 mMol) 5-Methansulfonamido-4-nitro-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)-pyrazol werden in 40 ml Ethanol suspendiert und mit 1,1 ml (10,7 mMol) einer 70 %igen alkoholischen Isopropylaminlösung versetzt.
 20 Die entstehende klare Lösung wird im Vakuum eingeeengt.

Man erhält 3,4 g (100 % der Theorie) an 5-Methansulfonamido-4-nitro-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethylphenyl)-pyrazol Isopropylammoniumsalz vom Schmelzpunkt 188°C.

Beispiel 7

0192951

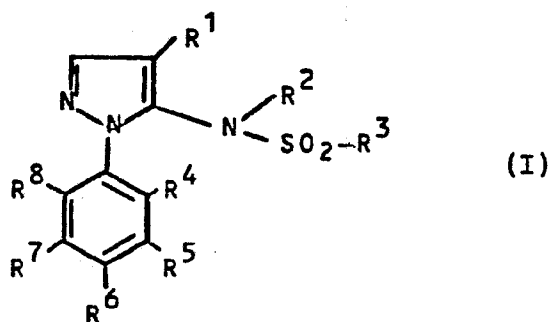
nach Verfahren (c):

5 1,5 g (4,0 mMol) 5-Methansulfonamido-1-(2,6-dichlor-
4-trifluormethylphenyl)-pyrazol werden in 20 ml Ethanol
gelöst, auf 0°C bis 5°C abgekühlt und mit 1 ml kaltem
Ethylnitrit, sowie 1 ml konzentrierter Salzsäure ver-
10 setzt. Es wird ca. 6 Stunden bei 0°C bis 5°C und vier-
zehn Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Lösungs-
mittel wird im Vakuum abdestilliert, der Rückstand in
20 ml Methylenchlorid und 10 ml Wasser aufgenommen,
die wäßrige Phase mit Natriumacetat-Lösung auf pH 3
gebracht und die organische Phase danach abgetrennt,
15 mit Kochsalzlösung gewaschen und über Magnesiumsulfat
getrocknet. Nach dem Entfernen des Lösungsmittels im
Vakuum erhält man 1,4 g (87 % der Theorie) 5-Methan-
sulfonamido-4-nitroso-1-(2,6-dichlor-4-trifluormethyl-
phenyl)-pyrazol vom Schmelzpunkt 151°C-153°C.

20





In entsprechender Weise und gemäß den allgemeinen Her-
stellungsangaben erhält man die in der folgenden Ta-
belle aufgeführten 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der
allgemeinen Formel (I),

25



30

Tabelle 2

Bsp Nr	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Schmelzpunkt(°C)
8	H	H		Cl	H	CF ₃	H	H	150
9	H	H		Cl	H	CF ₃	H	Cl	126
10	H	H	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	H	137-138
11	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	Glas (cm ⁻¹): IR (cm ⁻¹): symSO ₂ = 1165
12	H	H	CH ₃	Cl	H	-SO ₂ CF ₃	H	Cl	Glas (cm ⁻¹): IR (cm ⁻¹): symSO ₂ = 1165
13	H	H	CH ₃ -(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CF ₃	H	Cl	Oel (cm ⁻¹): IR (cm ⁻¹): symSO ₂ = 1145
14	NO ₂	H		Cl	H	CF ₃	H	Cl	180-181
15	NO ₂	H		Cl	H	CF ₃	H	H	150-151
16	NO ₂	H	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	H	64


0192951

Tabelle 2 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Schmelzpunkt (°C)
17	NO ₂	H	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	76
18	NO ₂	H	CH ₃ -(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CF ₃	H	Cl	155-157
19	NO ₂	H	ClCH ₂ -	Cl	H	CF ₃	H	Cl	172-175
20	NO ₂	H	CH ₃	Cl	H	-SO ₂ CF ₃	H	Cl	209-211
21	NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	CF ₃	H	Cl	133 - 138 (Zers.)
22	H	H	CF ₃	Cl	H	CF ₃	H	Cl	300
23	NO ₂	K [⊕]	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	Cl	>270 (Zers)
24	NO ₂	1/2Mg ^{2⊕}	CH ₃	Cl	H	CF ₃	H	Cl	150-155
25	NO ₂	H ₃ N [⊕] -CH(CH ₃) ₂	CH ₃ -(CH ₂) ₅ -	Cl	H	CF ₃	H	Cl	72
26	NO ₂	H ₃ N [⊕] -CH(CH ₃) ₂	ClCH ₂ -	Cl	H	CF ₃	H	Cl	128-129

0192951

Tabelle 2 (Fortsetzung)

Bsp.Nr	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Schmelzpunkt (°C)
27	NO ₂	H ₃ N [⊕] -CH(CH ₃) ₂	CF ₃	Cl	H	CF ₃	H	Cl	53 - 60
28	NO ₂	H ₃ N [⊕] -CH(CH ₃) ₂		Cl	H	CF ₃	H	Cl	64-70 (Zers.)
29	NO ₂	H ₃ N [⊕] -CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	H	SO ₂ CF ₃	H	Cl	177-180
30	NO ₂	K [⊕]	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	> 250
31	NO ₂	1/2 Mg ^{2⊕}	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	147
32	NO ₂	1/2 Zn ^{2⊕}	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	106-117
33	NO ₂	H ₃ N [⊕] -CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	105 (Zers.)
34	NO ₂	1/2 Mn ^{2⊕}	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	114 (Zers.)
35	NO ₂	Na [⊕]	CH ₃	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	> 250

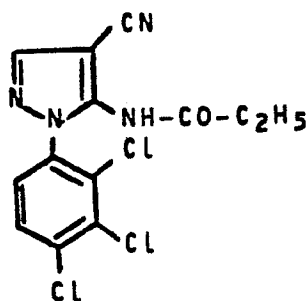
Le A 23 543 Ausland

0192951

Anwendungsbeispiele

- 5 In den folgenden Anwendungsbeispielen wurde die nachstehend aufgeführte Verbindung als Vergleichssubstanz eingesetzt:

10



(A)

15

4-Cyano-5-propionamido-1-(2,3,4-trichlorophenyl)-pyrazol
(bekannt aus DE-OS 3 226 513)

20

25

30

Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät und nach 24 Stunden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration
20 in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

25 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
 100 % = totale Vernichtung

30 Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit ebenso wie in der Nutzpflanzenselektivität gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test die Verbindungen der folgenden Herstellungsbeispiele: (6), (23)

Beispiel B

5 Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 2000 l Wasser/ha die jeweils
20 gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

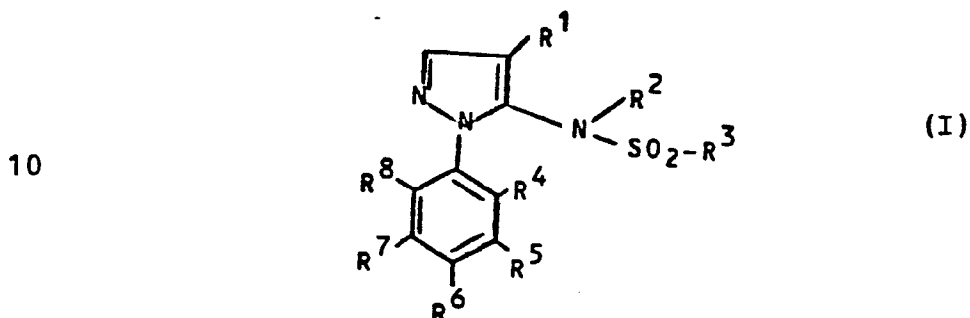
25 Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

30 Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit sowie in der Nutzpflanzenselektivität gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen gemäß folgender Herstellungsbeispiele: (6), (23)

Patentansprüche

- 5 1. 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der Formel (I)



in welcher

15

R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso oder Halogen steht,

20

R^2 für Wasserstoff, Alkyl, für einen Rest R^3-SO_2- oder für ein salzartig gebundenes anorganisches oder organisches Kation steht,

25

R^3 für Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Hydroxyalkyl, Alkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

30

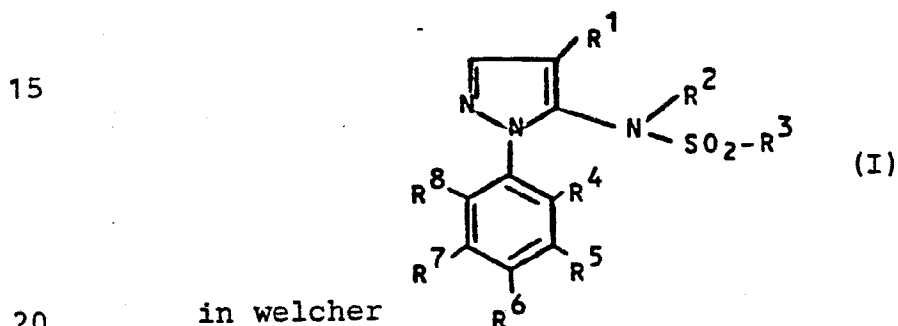
R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Nitro, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder für einen Rest $-S(O)_n-R^9$ stehen und

5 R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4
und R^6 für die gleichen Reste wie R^4 und R^6
stehen und zusätzlich für Wasserstoff stehen,
wobei

R^9 für Alkyl, Halogenalkyl, Amino, Alkylamino oder
Dialkylamino steht und

10 n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht.

2. 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der Formel (I)



R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso oder Halogen
steht,

25 R^2 für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes
Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, für einen
Rest R^3 -SO₂- oder für ein Äquivalent eines
Alkali- oder Erdalkali- oder Übergangsmetall-
kations oder für ein gegebenenfalls substitu-
iertes Ammoniumion steht,

30

- 5 R^3 für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkenyl, Halogenalkyl, Alkoxyalkyl oder Hydroxyalkyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen und gegebenenfalls bis zu 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Nitro sowie jeweils niederes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Halogenalkyl substituiertes Benzyl oder Phenyl steht,
- 10
- 15 R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Halogen oder für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen außerdem für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen und bis zu 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen oder für einen Rest $-S(O)_n-R^9$ stehen, und
- 20
- 25 R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4 und R^6 für die gleichen Reste wie R^4 und R^6 stehen und zusätzlich für Wasserstoff stehen, wobei
- 30 R^9 für Amino, sowie für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Halogenalkyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen und im Fall des Halogenalkyl mit bis zu 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und

n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht.

- 5 3. 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazole der Formel (I)
in welcher

R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso, Fluor, Chlor,
Brom oder Iod steht,

10 R^2 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl,
n-, i-, s- oder t-Butyl, für einen Rest R^3-SO_2-
oder für ein Äquivalent eines Natrium-, Kalium-,
15 Magnesium-, Calcium-, Barium-, Kupfer-, Zink-,
Mangan-, Zinn-, Eisen-, Cobalt- oder Nickelions
steht, oder für ein gegebenenfalls ein- bis
dreifach gleich oder verschieden durch Methyl,
Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl
oder durch Phenyl substituiertes Ammoniumion
20 steht,

R^3 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s-
oder t-Butyl, Allyl, Butenyl, Methoxymethyl, Me-
thoxyethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Chlorme-
25 thyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Cyclopropyl,
Cyclopentyl, Cyclohexyl oder für jeweils gege-
benenfalls ein- bis dreifach gleich oder ver-
schieden substituiertes Benzyl oder Phenyl
steht, wobei als Substituenten infrage kommen:
30 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl,
Methoxy, Methylthio oder Trifluormethyl,

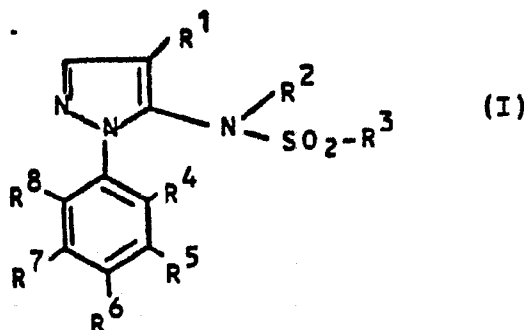
- 5 R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Nitro,
Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n- und
i-Propyl, n-, i-, s- und t-Butyl, für Methoxy,
Ethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, für
Trifluormethyl, Trichlormethyl, Dichlorfluor-
methyl, Difluorchlormethyl, Chlormethyl,
10 Dichlormethyl, Difluormethyl, Pentafluorethyl,
Tetrafluorethyl, Trifluorchlorethyl, Trifluor-
ethyl, Difluordichlorethyl, Trifluordichlor-
ethyl, Pentachlorethyl, für Trifluormethoxy,
Trichlormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Difluor-
chlormethoxy, Chlormethoxy, Dichlormethoxy,
15 Difluormethoxy, Pentafluorethoxy, Tetrafluorethoxy,
Trifluorchlorethoxy, Trifluorethoxy, Difluordi-
chlorethoxy, Trifluordichlorethoxy, Pentachlor-
ethoxy oder für einen Rest $-S(O)_n-R^9$ stehen
und
20 R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4 und
 R^6 für die gleichen Reste wie R^4 und R^6 stehen
und zusätzlich für Wasserstoff stehen, wobei
25 R^9 für Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethyl-
amino, Diethylamino, Fluordichlormethyl, Di-
fluormethyl, Tetrafluorethyl, Trifluorchlorethyl,
Trifluormethyl, Methyl oder Ethyl steht und
30 n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht.

0192951

4. Verfahren zur Herstellung von 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazolen der Formel (I),

5

10



in welcher

15

R^1 für Wasserstoff, Nitro, Nitroso oder Halogen steht,

20

R^2 für Wasserstoff, Alkyl, für einen Rest R^3-SO_2- oder für ein salzartig gebundenes anorganisches oder organisches Kation steht,

25

R^3 für Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Hydroxyalkyl, Alkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

30

R^4 und R^6 unabhängig voneinander für Cyano, Nitro, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder für einen Rest $-S(O)_n-R^9$ stehen und

R^5 , R^7 und R^8 unabhängig voneinander und von R^4 und R^6 für die gleichen Reste wie R^4 und R^6 stehen und zusätzlich für Wasserstoff stehen, wobei

R^9 für Alkyl, Halogenalkyl, Amino, Alkylamino
oder Dialkylamino steht und

5

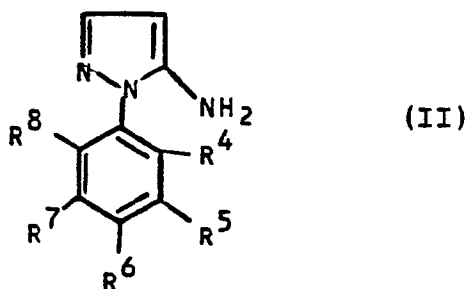
n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,

dadurch gekennzeichnet, daß man

10

(a) 5-Aminopyrazole der Formel (II),

15



in welcher

20

R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Sulfonylchloriden der Formel (III),

25



in welcher

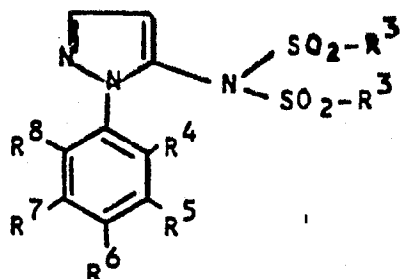
30

R^3 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines
Säurebindemittels umgesetzt,
oder

(b) die nach Verfahren (a) erhältlichen Bisulfonylamine der Formel (Ia),

5



(Ia)

10

in welcher

R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die oben angegebene Bedeutung ahben

15

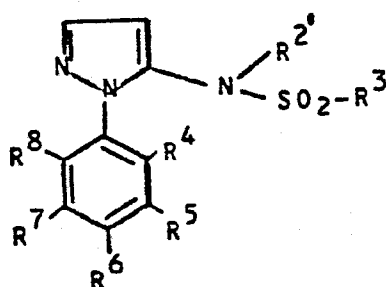
mit Basen gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels spaltet,

20

oder

(c) die nach Verfahren (a) oder (b) erhältlichen 5-Sulfonamido-pyrazole der Formel (Ib),

25



(Ib)

30

in welcher

$R^{2'}$ für Wasserstoff oder für einen Rest R^3-SO_2-
steht und

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben,

mit elektrophilen Agenzien der Formel (IV),



in welcher

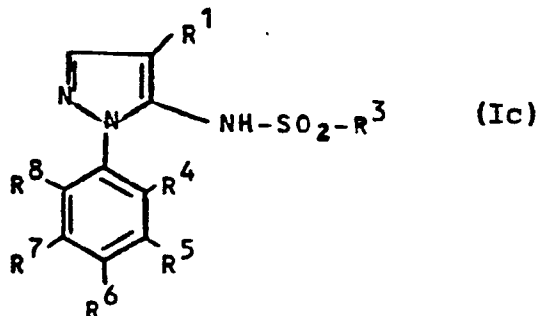
$R^{1'}$ für Halogen, Nitroso oder Nitro steht und

E für eine elektronenanziehende Abgangsgruppierung steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oder Reaktionshilfsmittels in 4-Stellung substituiert,

oder

(d) die nach Verfahren (a), (b) oder (c) erhältlichen 5-Sulfonamido-pyrazole der Formel (Ic),



in welcher

5 $R^1, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben,

entweder

10 (C) mit Alkylierungsmitteln der Formel (V),



in welcher

15

$R^{2''}$ für Alkyl steht und
 E' für eine elektronenanziehende Abgangsgruppe steht,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels bzw. Katalysators am Stickstoffatom der Sulfonamidogruppe alkyliert,

25

oder

(B) mit Verbindungen der Formel (VI),

30



in welcher

M^{\oplus} für ein Äquivalent eines anorganischen
oder organischen Kations steht und

G^{\ominus} für ein Äquivalent eines geeigneten
Gegenions steht,

umsetzt oder mit primären, sekundären
oder tertiären Aminen gegebenenfalls
in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
am Stickstoff der Sulfonamidogruppe
ein Salz bildet.

5. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt
an mindestens einem 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazol
der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4.
6. Verfahren zur Bekämpfung von Unkräutern, dadurch
gekennzeichnet, daß man 5-Sulfonamido-1-aryl-pyra-
zole der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4
auf Unkräuter und/oder ihren Lebensraum einwirken
läßt.
7. Verwendung von 5-Sulfonamido-1-aryl-pyrazolen der
Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 zur Be-
kämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs.
8. Verfahren zur Herstellung von herbiziden Mitteln,
dadurch gekennzeichnet, daß man 5-Sulfonamido-1-
aryl-pyrazole der Formel (I) gemäß den Ansprüchen
1 bis 4 mit Streckmitteln und/oder oberflächen-
aktiven Mitteln vermischt.